### 特 許 協 力 条 約

PCT

特許性に関する国際予備報告(特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条) (PCT36条及びPCT規則70)

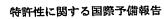
REC'D 10	SEP 2004
WIPO	PCT

出願人又は代理人 の書類記号 R-26	今後の手続きについ	ては、様式PCT/	IPEA/416を参	照すること。
国際出願番号 PCT/JP03/10607	国際出願日 (日.月.年) 22.		優先日 (日.月.年) 23.	
国際特許分類 (IPC) Int. Cl <sup>7</sup>	A61K31/55	75, 9/08, 4	7/16, A61P2	7/06
出願人(氏名又は名称) 参天製薬株式会社				
1. この報告書は、PCT35条に基づき 法施行規則第57条 (PCT36条) の	D規定に従い送付する	ó.		
2. この国際予備審査報告は、この表紙を	<b>≥含めて全部で</b>	4 ~	ジからなる。	
3. この報告には次の附属物件も添付される	ιτいる。 ページであ≀	5.		
補正されて、この報告の基系 囲及び/又は図面の用紙(				明細書、請求の範
第 I 欄4. 及び補充欄に示 国際予備審査機関が認定し		こおける国際出願の	<b>引示の範囲を超えた補正</b>	Eを含むものとこの
b 電子媒体は全部で 配列表に関する補充欄に示す ブルを含む。(実施細則第8		タ読み取り可能な形式		種類、数を示す)。 <sub>引表</sub> に関連するテー
4. この国際予備審査報告は、次の内容	 を含む。			
<ul> <li>※ 第 I 欄 国際予備審査章</li> <li>第 II 欄 優先権</li> <li>※ 第 II 欄 新規性、進歩性</li> <li>第 IV欄 発明の単一性の</li> </ul>	生又は産業上の利用可 0欠如			
第V欄 PCT35条(	<b>訳及び説明</b> 文献 備	、進歩性又は産業上の	の利用可能性についての	の見解、それを裏付
国際予備審査の請求書を受理した日 22.03.2004		国際予備審査報告 17	を作成した日 . 08.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁(IPEA/JP		特許庁審査官(権		4C 9444
郵便番号100-8915 東京都千代田区設が関三丁目4		榊原	班 <del>了</del> 3581−1101 :	±46 0400

# 特許性に関する国際予備報告

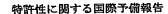
国際出願番号 PCT/JP03/10607

第1欄 報告の基礎	
1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、	国際出願の言語を基礎とした。
□ この報告は、	一般とした。
2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条 た差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この幸	(PCT14条) の規定に基づく命令に応答するために提出され 限告に添付していない。)
✓ 出願時の国際出願書類	
明細書	出願時に提出されたもの  付けで国際予備審査機関が受理したもの  付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 ページ/図*、 第 ページ/図*、	出願時に提出されたもの  付けで国際予備審査機関が受理したもの  付けで国際予備審査機関が受理したもの
配列表又は関連するテーブル 配列表に関する補充欄を参照すること。 3. 補正により、下記の書類が削除された。	
明細書 第	ページ 項 ページ/図 ること)
4. この報告は、補充欄に示したように、この報告に えてされたものと認められるので、その補正がさ	添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超れなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))
□ 明細書 第 請求の範囲 第 図面 第 配列表(具体的に記載すること) □ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載す	ページ/図
* 4. に該当する場合、その用紙に"superseded"と記	、 入されることがある。



国際出願番号 PCT/JP03/10607

	不作成
1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、 審査しない。	進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により
国際出願全体	
※ 請求の範囲 請求の範囲1−4の一部	
理由:  二 この国際出願又は請求の範囲  次の事項を内容としている(具体的に記載すること)。	は、国際予備審査をすることを要しない
·	,
明細書、請求の範囲若しくは図面(次に示す部分)又は請求の 記載が、不明確であるため、見解を示すことができない(具体	D範囲の 本的に記載すること)。
·	
	ļ
<u> </u>	
全部の請求の範囲又は請求の範囲 	が、明細書による十分な
□ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 裏付けを欠くため、見解を示すことができない。 □ 請求の範囲 請求の範囲 1 - 4 の一部	が、明細書による十分な だついて、国際調査報告が作成されていない。
裏付けを欠くため、見解を示すことができない。	について、国際調査報告が作成されていない。 (塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のため
■ 裏付けを欠くため、見解を示すことができない。	について、国際調査報告が作成されていない。 (塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のため。  提出されていない。
■ 裏付けを欠くため、見解を示すことができない。    ※ 請求の範囲	について、国際調査報告が作成されていない。 (塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のため。
■ 裏付けを欠くため、見解を示すことができない。  ▼ 請求の範囲	について、国際調査報告が作成されていない。 (塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のため。    提出されていない。   所定の基準を満たしていない。   提出されていない。   所定の基準を満たしていない。
■ 裏付けを欠くため、見解を示すことができない。  図 請求の範囲 請求の範囲 1 - 4 の一部  図 ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書 C のガイドライン)に定める基準を、次の点で満たしていない  書面による配列表が コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が	について、国際調査報告が作成されていない。 (塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のため。    提出されていない。   所定の基準を満たしていない。   提出されていない。   所定の基準を満たしていない。
■ 裏付けを欠くため、見解を示すことができない。    図	について、国際調査報告が作成されていない。 (塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のため。    提出されていない。   所定の基準を満たしていない。   提出されていない。   所定の基準を満たしていない。



国際出願番号 PCT/JP03/10607

第V	「棡 新規性、進歩性又は産業上 それを裏付ける文献及び説	の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2)) に定める 明	見解、 —————————
1.	<b>見解</b>		
	新規性(N)	請求の範囲 <u>1-4の一部</u> 請求の範囲	
	進歩性(IS)	請求の範囲 請求の範囲 <u>1-4の一</u> 部	
	産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲 <u>1-4の一部</u> 請求の範囲	

# 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

猫文

**X間** 1.JP 11-500122 A(アルコン ラボラトリーズ インコーポレイテッド),

1999.01.06 & US 6011062 A 2. JP 2002/520368 A (アルコン ラボラトリーズ インコーポレイテッド),

2002. 07. 09 & WO 00/03736 A1

説明

です。 請求の範囲1-4の一部に記載された発明は国際調査報告に引用された文献1-

ンとしてラタノプロストが記載されており、かつ、pHを5.0あるいは6.0に 調節した眼用処方物の実施例が記載されている。

してみれば、プロスタグランジンとして0.01重量%のラタノプロストを用いたpH5.0~6.0程度の点眼剤を製造することは当業者にとって容易である。

加えて、文献1の第2図と第3図とを比較すると、pHが5.0に調節されたAの処方物の方がpHが7.4に調節された処方物Cに比してプロスタグランジンの安定性が高いことが示されているから、プロスタグランジンとしてラタノプロストを用いた点眼剤において、ラタノプロストが安定化されることを期待してpHを5.0に調節すること及び点眼剤のpHを5.0~6.0の前後で変化させてラタノプロスト安定化の効果を確認してみることも、当業者にとって容易である。

請求の範囲1-4の一部に記載された発明は、産業上の利用可能性を有する。

# Translation





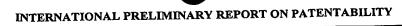
# **PCT**

# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference R-26		FOR FURTHER ACT	ION	See Form PCT/IPEA/416		
Inter	national application No. PCT/JP2003/010607	International filing date ( 22 August 2003 (		Priority date (day/month/year)  23 August 2002 (23.08.2002)		
Inter	International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 31/5575, 9/08, 47/16, A61P 27/06					
App	Applicant SANTEN PHARMACEUTICAL CO., LTD.					
1.	<ol> <li>This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.</li> </ol>					
2			ncluding this cover	sheet.		
3	-		1 1 1 - 6	shoots on follows:		
	a. (sent to the applicant an	d to the International Bure	au) a total of	sneets, as follows.		
	sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).					
	sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.					
	b. (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s))  , containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the					
	Administrative Instructions).  4. This report contains indications relating to the following items:					
Box No. I Basis of the report						
Box No. II Priority						
	Box No. III Non-establi	shment of opinion with reg	gard to novelty, inve	entive step and industrial applicability		
1	Box No. IV Lack of unity of invention					
	Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicabilit citations and explanations supporting such statement			velty, inventive step or industrial applicability;		
Box No. VI Certain documents cited						
Box No. VII Certain defects in the international a						
Box No. VIII Certain observations on the international application						
	Date of submission of the demand		Date of completion	on of this report		
	22 March 2004 (22.	03.2004)	1′	7 August 2004 (17.08.2004)		
1	Name and mailing address of the IPEA/I	TP .	Authorized office	or —		
	Facsimile No.		Telephone No.			



Internal lapplication No.
PCT/JP2003/010607

Box No. 1	Ba	sis of the report
1. With rootherw	ise indi/	the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless cated under this item.
	This re	port is based on translations from the original language into the following language, is language of a translation furnished for the purpose of:
	ir	nternational search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
	□ p	ublication of the international application (under Rule 12.4)
	ir	nternational preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)
	-	
furnis	hed to t re not a	to the elements of the international application, this report is based on (replacement sheets which have been the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" nnexed to this report):
$\boxtimes$	The int	ernational application as originally filed/furnished
	the des	cription: , as originally filed/furnished
	pages	the state of the s
	pages*	to 11 at the Australia on
	pages*	10001700 07 11.10 11.10 11.10
	the cla	ims: , as originally filed/furnished
	pages	
	pages*	in all houst in Authority on
Ì	pages'	11 die Ausbergieren
	pages'	
	the dr	awings: , as originally filed/furnished
	pages	11 Mills Australian on
	pages	11 Although on
	pages	
	a seq	uence listing and/or any related table(s) - see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.
_	ı	
3	The a	amendments have resulted in the cancellation of:
1		the description, pages
1		the claims, Nos.
1		the drawings, sheets/figs
1		the sequence listing (specify):
		any table(s) related to sequence listing (specify):
4.	_ mad	report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been e, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box to 70.2(c)).  the description, pages
	L	any tanic(s) related to sequence risking (speed).
* If	item 4 d	applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

Вох	No. 111	II Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
The	questi licable	tions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrial a have not been examined in respect of:
[		the entire international application.
1	$\boxtimes$	claims Nosa portion of claims 1-4
1	because	e:
		the said international application, or the said claims Nos
ļ		
		the description, claims or drawings (indicate particular elements below) or said claims Nosare so unclear that no meaningful opinion could be formed (specify):
		are so unclear that no meaning for opinion could be some (-p = 5),
1		
l		
		•
1		
1		
	$\Box$	the claims, or said claims Nos are so inadequately supported
	ш	by the description that no meaningful opinion could be formed.
	$\boxtimes$	no international search report has been established for said claims Nos. a portion of claims 1-4
		the nucleotide and/or amino acid sequence listing does not comply with the standard provided for in Annex C of the
١		Administrative Instructions in that: the written form has not been furnished
١		does not comply with the standard
		the computer readable form has not been furnished
		does not comply with the standard
		,
		the tables related to the nucleotide and/or amino acid sequence listing, if in computer readable form only, do not complet the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions.
		see Supplemental Box for further details.

1. Statement  Novelty (N)  Claims  a portion of claims 1-4					
Claims	a portion of claims 1-4	<del></del>			
Claims		NO			
Claims	·	YES			
Claims	a portion of claims 1-4	ио			
(A) Claims	a portion of claims 1-4	YES			
Claims		NO			
	Claims Claims Claims Claims Claims Claims Claims	Claims  Claims  Claims  a portion of claims 1-4  (A) Claims  a portion of claims 1-4			

2. Citations and explanations (Rule 70.7)

# Documents

 JP 11-500122 A (Alcon Laboratories, Inc.), January 6, 1999 & US 6011062 A

JP 2002/520368 A (Alcon Laboratories, Inc.),
 July 9, 2002 & WO 00/03736 A1

# Commentary

Based on the descriptions in documents 1 and 2 cited in the international search report, the inventions described in parts of claims 1-4 lack an inventive step.

The Examples of document 1, which discloses a prostaglandin composition that remains stable in storage, describe ophthalmological formulations A and B that are adjusted to pH 5.0 and contain 0.01 wt.% prostaglandin. In addition, claim 8 and page 17 of document 1 describe latanoprost as a prostaglandin, and claim 11 states that the concentration of prostaglandin is 0.0001 to 0.1 wt.%

Similarly, document 2, which describes a prostaglandin pharmaceutical product, lists latanoprost as a prostaglandin and describes examples of formulations in which the pH is adjusted to 5.0 or 6.0.

Thus, persons skilled in the art can easily prepare eyedrops with a pH range of 5.0-6.0 that contain 0.01 wt.% latanoprost as a prostaglandin.

In addition, when we compare Figures 2 and 3 of document 1, they illustrate that formulation A which is adjusted to a pH of 5.0 has higher prostaglandin stability than formulation C, which is adjusted to pH 7.4. Therefore, persons skilled in the art can easily adjust the pH to 5.0 with the expectation that latanoprost will be stabilized in an ophthalmological formulation that uses latanoprost as a prostaglandin, and adjust the pH of the ophthalmological formulation above and below the range of 5.0-6.0 to verify the effectiveness of latanoprost stabilization.

The inventions described in parts of claims 1-4 have industrial applicability.